

PCT

世界知的所有権機関
国際事務局

特許協力条約に基づいて公開された国際出願

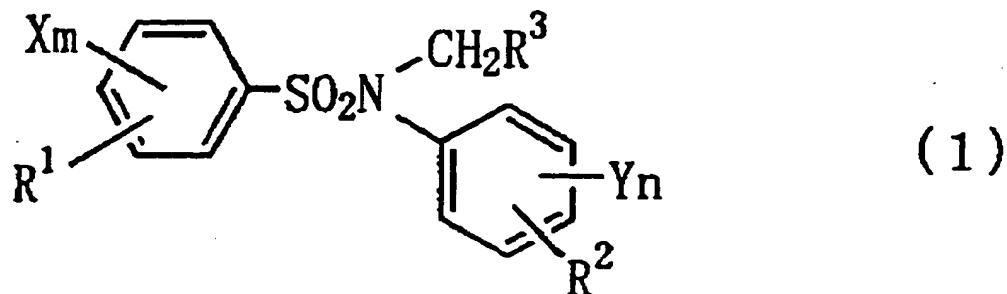


<p>(51) 国際特許分類 C07C 311/21, 311/29, C07D 213/42, A01N 41/06, 43/40</p>	<p>A1</p>	<p>(11) 国際公開番号 WO97/00857</p> <p>(43) 国際公開日 1997年1月9日 (09.01.97)</p>
<p>(21) 国際出願番号 PCT/JP96/01545</p> <p>(22) 国際出願日 1996年6月6日 (06.06.96)</p> <p>(30) 優先権データ 特願平7/154484 1995年6月21日 (21.06.95) JP 特願平7/330076 1995年12月19日 (19.12.95) JP</p> <p>(71) 出願人 (米国を除くすべての指定国について) 大塚化学株式会社 (OTSUKA KAGAKU KABUSHIKI KAISHA)[JP/JP] 〒540 大阪府大阪市中央区大手通3丁目2番27号 Osaka, (JP)</p> <p>(72) 発明者: および (75) 発明者/出願人 (米国についてのみ) 中川博文 (NAKAGAWA, Hirohumi)[JP/JP] 〒771-34 徳島県名西郡神山町下分子下喜来81 Tokushima, (JP) 後藤田悟司 (GOTODA, Satoshi)[JP/JP] 〒779-33 徳島県麻植郡川島町大字川島724 Tokushima, (JP) 村井啓三郎 (MURAI, Keizaburo)[JP/JP] 〒779-02 徳島県鳴門市大麻町板東字広塚1-49 Tokushima, (JP)</p>		<p>和氣坂成一 (WAKISAKA, Seichi)[JP/JP] 〒772 徳島県鳴門市撫養町大桑島字北浜64 セジュール泉202号 Tokushima, (JP) 高尾 久 (TAKAO, Hisashi)[JP/JP] 〒771-02 徳島県板野郡北島町鯛浜字原135-11 Tokushima, (JP)</p> <p>(74) 代理人 弁理士 三枝英二, 外 (SAEGUSA, Eiji et al.) 〒541 大阪府大阪市中央区道修町1-7-1 北浜TNKビル Osaka, (JP)</p> <p>(81) 指定国 US, 欧州特許 (AT, BE, CH, DE, DK, ES, FI, FR, GB, GR, IE, IT, LU, MC, NL, PT, SE).</p> <p>添付公開書類 国際調査報告書</p>
<p>(54) Title: SULFONAMIDE DERIVATIVES AND INSECTICIDE, MITICIDE AND NEMATICIDE CONTAINING THE SAME</p> <p>(54) 発明の名称 スルホンアミド誘導体並びに該誘導体を含む殺虫、殺ダニ及び殺線虫剤</p> <div data-bbox="516 1289 1193 1554" data-label="Chemical-Block"> <p style="text-align: right;">(1)</p> </div> <p>(57) Abstract A sulfonamide derivative represented by general formula (1) which is useful as an insecticide, miticide and nematocide, wherein R¹ and R² represent each hydrogen, haloalkyl or halogeno; R³ represents ethynyl, cyano, alkoxy, or alkoxycarbonyl; X and Y represent each hydrogen, halogeno, alkyl, alkoxy, haloalkyl, haloalkoxy, phenoxy, phenyl, pyridyloxy, cyano, nitro, alkylthio, alkylsulfonyl, etc.; and m and n are each from 1 to 3.</p>		

BEST AVAILABLE COPY

(57) 要約

本発明は、殺虫、殺ダニ及び殺線虫剤として有用なスルホンアミド誘導体を提供することを目的とする。本発明のスルホン酸アミド誘導体は下記一般式(1)で表わされる。



[式中、R¹、R²は水素、ハロアルキル、ハロゲンを、R³はエチニル、シアノ、アルコキシ、アルコキシカルボニルを、X、Yは水素、ハロゲン、アルキル、アルコキシ、ハロアルキル、ハロアルコキシ、フェノキシ、フェニル、ピリジルオキシ、シアノ、ニトロ、アルキルチオ、アルキルスルホニル等を、m、nは1～3を示す。]

情報としての用途のみ

PCTに基づいて公開される国際出願をパンフレット第一頁にPCT加盟国を同定するために使用されるコード

AL	アルバニア	DE	ドイツ	LI	リヒテンシュタイン	PL	ポーランド
AM	アルメニア	DK	デンマーク	LK	セイロン	PT	ポルトガル
AT	オーストリア	EE	エストニア	LR	リベリア	RO	ルーマニア
AU	オーストラリア	ES	スペイン	LS	レソト	RU	ロシア連邦
AZ	アゼルバイジャン	FI	フィンランド	LT	リトアニア	SD	スーダン
BA	ボスニア・ヘルツェゴビナ	FR	フランス	LU	ルクセンブルグ	SE	スウェーデン
BB	バルバドス	GA	ガボン	LV	ラトヴィア	SG	シンガポール
BE	ベルギー	GB	イギリス	MC	モナコ	SI	スロベニア
BF	ブルキナ・ファソ	GE	グルジア	MD	モルドヴァ共和国	SK	スロバキア
BG	ブルガリア	CN	中国	MG	マダガスカル	SN	セネガル
BJ	ベナン	GR	ギリシャ	MK	マケドニア共和国	SZ	スワジランド
BR	ブラジル	HU	ハンガリー	ML	マリ	TD	チャド
BS	バハマ	IE	アイルランド	MN	モンゴル	TG	トーゴ
CA	カナダ	IL	イスラエル	MR	モーリタニア	TJ	タジキスタン
CC	中央アフリカ共和国	IS	アイスランド	MW	マラウイ	TM	トルクメニスタン
CF	コンゴ	IT	イタリア	MX	メキシコ	TR	トルコ
CH	スイス	JP	日本	NE	ニジェール	TT	トリニダード・トバゴ
CI	コート・ジボアール	KE	ケニア	NL	オランダ	UA	ウクライナ
CM	カメルーン	KG	キルギスタン	NO	ノルウェー	UG	ウガンダ
CN	中国	KP	朝鮮民主主義人民共和国	NZ	ニュージーランド	US	アメリカ合衆国
CU	キューバ	KR	大韓民国			UZ	ウズベキスタン
CZ	チェコ共和国	KZ	カザフスタン			VN	ヴェトナム

明 細 書

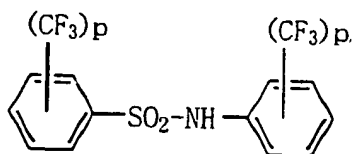
スルホンアミド誘導体並びに該誘導体
を含む殺虫、殺ダニ及び殺線虫剤

技 術 分 野

- 5 本発明はスルホンアミド誘導体並びに該誘導体を含む
殺虫、殺ダニ及び殺線虫剤に関する。

背 景 技 術

- 今日までにスルホンアミド誘導体の中には生物活性を
有する各種化合物が知られている。例えば特開平 3 -
10 2 5 8 7 7 1 号公報には、1, 2, 4 - オキサジアゾー
ル基を有するスルホンアミド誘導体が除草活性を有する
ことが記載されている。しかしながら上記公報には、該
公報記載の化合物が殺虫活性、殺ダニ活性及び殺線虫活
性を有していることは教示も示唆もなされていない。ま
15 たフランス国特許第 9 5 7 4 9 3 号明細書には、一般式



[式中 p は 1 ~ 3 の整数を示す。]

- 20 で表されるスルホンアミド誘導体が殺ダニ活性を有する
ことが開示されている。しかしながら、フランス国特許
明細書には、上記一般式で表されるスルホンアミド誘導

体が、殺ダニ活性以外の殺虫活性や殺線虫活性等の生物活性を有しているのか否かについては、全く教示されていない。

発 明 の 開 示

- 5 本発明の1つの目的は、農業用として優れた生物活性を有する薬剤を提供することにある。

本発明の他の1つの目的は、農業上問題となる各種害虫に対し極めて強力な殺虫活性を有するスルホンアミド誘導体を提供することにある。

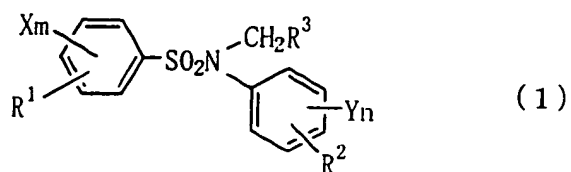
- 10 本発明の他の1つの目的は、強力な殺ダニ活性及び殺線虫活性を有するスルホンアミド誘導体を提供することにある。

本発明のその他の特徴は以下の記載により明らかにする。

- 15 本発明者等は、農業用として優れた生物活性を有する薬剤を開発するべく、スルホンアミド誘導体につき種々検討した結果、下記一般式(1)で表わされる化合物が農業上問題となる各種害虫に対し極めて強力な殺虫活性を有していると共に、強力な殺ダニ活性や殺線虫活性をも有していることを見い出した。本発明は斯かる知見に
20 基づき完成されたものである。

本発明のスルホンアミド誘導体は、文献未記載の新規

化合物であって、下記一般式



5

〔式中、 R^1 及び R^2 は、同一又は異なって、水素原子、低級ハロアルキル基又はハロゲン原子を示す。 R^3 は、エチニル基、シアノ基、低級アルコキシ基又は低級アルコキシカルボニル基を示す。 X 及び Y は、同一又は異な

10 て、水素原子、ハロゲン原子、低級アルキル基、低級アルコキシ基、低級ハロアルキル基、低級ハロアルコキシ基、置換基を有することのあるフェノキシ基、置換基を有することのあるフェニル基、置換基を有することのあるピリジルオキシ基、シアノ基、ニトロ基、低級アルキルチオ基又は低級アルキルスルホニル基を示す。 m 及び

15 n はそれぞれ1～3の整数を示す。〕

で表わされるスルホンアミド誘導体である。

本発明のスルホンアミド誘導体は、強力な殺虫活性を有すると共に、強力な殺ダニ及び殺線虫活性をも有して

20 おり、殺虫、殺ダニ及び殺線虫剤として有用である。

本明細書において示される各基は、具体的には以下の通りである。

低級ハロアルキル基としては、例えばトリフルオロメ
チル、トリクロロメチル、クロロメチル、ブromoメチル、
フルオロメチル、ヨードメチル、ジフルオロメチル、ジ
ブromoメチル、2-クロロエチル、2, 2, 2-トリフ
5 ルオロエチル、2, 2, 2-トリクロロエチル、3-ブ
ロモプロピル、3-クロロプロピル、2, 3-ジクロロ
プロピル、4, 4, 4-トリクロロプロピル、4-フルオ
ロブチル、5-クロロペンチル、3-クロロ-2-メチ
ルプロピル、5-ブromoヘキシル、5, 6-ジクロロヘ
10 キシル基等の置換基としてハロゲン原子を1~3個有す
る炭素数1~6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基を例示で
きる。

ハロゲン原子としては、例えば弗素原子、塩素原子、
臭素原子及び沃素原子が挙げられる。

15 低級アルコキシ基としては、例えばメトキシ、エトキ
シ、プロポキシ、イソプロポキシ、ブトキシ、tert
-ブトキシ、ペンチルオキシ、ヘキシルオキシ基等の炭
素数1~6の直鎖又は分枝鎖状アルコキシ基を例示でき
る。

低級アルコキシカルボニル基としては、例えば、メト
キシカルボニル、エトキシカルボニル、プロポキシカル
ボニル、イソプロポキシカルボニル、ブトキシカルボニ

ル、イソブトキシカルボニル、*t*-ブトキシカルボニル基等の炭素数1～6の直鎖又は分枝状アルコキシカルボニル基を例示できる。

5 低級アルキル基としては、例えばメチル、エチル、プロピル、イソプロピル、ブチル、イソブチル、*tert*-ブチル、ペンチル、ヘキシル基等の炭素数1～6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基を挙げることができる。

低級ハロアルコキシ基としては、例えば、トリフルオ
ロメトキシ、トリクロロメトキシ、クロロメトキシ、ブ
10 ロモメトキシ、フルオロメトキシ、ヨードメトキシ、ジ
フルオロメトキシ、ジブロモメトキシ、2-クロロエト
キシ、2, 2, 2-トリフルオロエトキシ、2, 2, 2-
トリクロロエトキシ、3-ブロモプロポキシ、3-ク
ロロプロポキシ、2, 3-ジクロロプロポキシ、4, 4,
15 4-トリクロロブトキシ、4-フルオロブトキシ、5-
クロロペンチルオキシ、3-クロロ-2-メチルプロポ
キシ、5-ブロモヘキシルオキシ、5, 6-ジクロロヘ
キシルオキシ基等の置換基としてハロゲン原子を1～3
20 個有する炭素数1～6の直鎖又は分枝鎖状アルコキシ基
を例示できる。

置換基を有することのあるフェノキシ基としては、例
えば、フェノキシ、2-メチルフェノキシ、3-メチル

フェノキシ、4-メチルフェノキシ、2-エチルフェノ
キシ、3-プロピルフェノキシ、4-ブチルフェノキシ、
2-ペンチルフェノキシ、3-ヘキシルフェノキシ、3,
4-ジメチルフェノキシ、3, 4, 5-トリメチルフェ
5 ノキシ、2-メトキシフェノキシ、3-メトキシフェノ
キシ、4-メトキシフェノキシ、2-エトキシフェノキ
シ、4-エトキシフェノキシ、3-プロポキシフェノキ
シ、4-プロポキシフェノキシ、4-ブトキシフェノキ
シ、2-ペンチルオキシフェノキシ、3-ヘキシルオキ
10 シフェノキシ、2, 4-ジメトキシフェノキシ、3, 4
-ジエトキシフェノキシ、3, 4, 5-トリメトキシフ
ェノキシ、2-ヒドロキシフェノキシ、3-ヒドロキシ
フェノキシ、4-ヒドロキシフェノキシ、2, 4-ジヒ
ドロキシフェノキシ、3, 4-ジヒドロキシフェノキシ、
15 2, 4, 6-トリヒドロキシフェノキシ、2-アセチル
オキシフェノキシ、3-プロピオニルオキシフェノキシ、
2-ベンジルオキシフェノキシ、3-ベンジルオキシフ
ェノキシ、4-ベンジルオキシフェノキシ、2-(2-
フェニルエトキシ)フェノキシ、3-(3-フェニルプ
20 ロポキシ)フェノキシ、4-(4-フェニルブトキシ)
フェノキシ、3-(1-フェニルエトキシ)フェノキシ、
2-(5-フェニルペンチルオキシ)フェノキシ、3-

- (6-フェニルヘキシルオキシ)フェノキシ、2, 4-ジベンジルオキシフェノキシ、3, 4-ジベンジルオキシフェノキシ、3, 4, 5-トリベンジルオキシフェノキシ、4-ブチリルオキシフェノキシ、2-ペンタノイルオキシフェノキシ、4-ヘキサノイルオキシフェノキシ、2, 4-ジアセチルオキシフェノキシ、2, 6-ジアセチルオキシフェノキシ、3, 4, 5-トリアセチルオキシフェノキシ、2-トリフルオロメトキシフェノキシ、3-(2-クロロエトキシ)フェノキシ、2-(3-ブロモプロポキシ)フェノキシ、4-ヨードメトキシフェノキシ、2-(2, 3-ジクロロプロポキシ)フェノキシ、3-(4-フルオロブトキシ)フェノキシ、4-(3-クロロ-2-メチルプロポキシ)フェノキシ、2-(5-ブロモヘキシルオキシ)フェノキシ、3-(5, 6-ジクロロヘキシルオキシ)フェノキシ、4-(2, 2, 2-トリクロロエトキシ)フェノキシ、2, 4-ビストリフルオロメトキシフェノキシ、2, 4, 6-トリ(トリフルオロメトキシ)フェノキシ、2-アミノメトキシフェノキシ、3-(1-アミノエトキシ)フェノキシ、4-(3-アミノプロポキシ)フェノキシ、2-(4-アミノブトキシ)フェノキシ、3-(5-アミノペンチルオキシ)フェノキシ、4-(6-アミノヘ

キシルオキシ) フェノキシ、 2-メチルアミノメトキシ
フェノキシ、 3-(2-プロピルアミノエトキシ) フェ
ノキシ、 2-(3-イソプロピルアミノプロポキシ) フ
ェノキシ、 4-(4-ブチルアミノブトキシ) フェノキ
シ、 2-(5-ペンチルアミノペンチルオキシ) フェノ
キシ、 3-(6-ヘキシルアミノヘキシルオキシ) フェ
ノキシ、 4-ジメチルアミノメトキシフェノキシ、 2-
(N-エチル-N-プロピルアミノメトキシ) フェノキ
シ、 2-メチル-4-メトキシフェノキシ、 2-メチル
10 -6-ヒドロキシフェノキシ、 4-メチル-2-(3-
ブromoプロポキシ) フェノキシ、 4-メトキシ-2-
(3-イソプロピルアミノプロポキシ) フェノキシ、 2
-フェニルフェノキシ、 3-フェニルフェノキシ、 4-
フェニルフェノキシ、 2-ニトロフェノキシ、 3-ニト
15 ロフェノキシ、 4-ニトロフェノキシ、 2, 3-ジニト
ロフェノキシ、 2, 4, 6-トリニトロフェノキシ、 2
-アミノフェノキシ、 3-アミノフェノキシ、 4-アミ
ノフェノキシ、 2, 4-ジアミノフェノキシ、 3, 4,
5-トリアミノフェノキシ、 4-アセチルアミノフェノ
20 キシ、 2-プロピオニルアミノフェノキシ、 3-ブチリ
ルアミノフェノキシ、 4-ペンタノイルアミノフェノキ
シ、 4-ヘキサノイルアミノフェノキシ、 2, 3-ジア

セチルアミノフェノキシ、2, 4, 6-トリアセチルア
ミノフェノキシ基等のフェニル環上に置換基として炭素
数1~6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基、炭素数1~6
の直鎖又は分枝鎖状アルコキシ基、水酸基、炭素数1~
5 6の直鎖又は分枝鎖状アルカノイルオキシ基、置換基と
してハロゲン原子を1~3個有する炭素数1~6の直鎖
又は分枝鎖状アルコキシ基、ニトロ基、置換基として炭
素数1~6の直鎖又は分枝鎖状アルカノイル基を有する
ことのあるアミノ基、フェニル基、及び置換基として炭
10 素数1~6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基を1~2個有
することのあるアミノ基を有する炭素数1~6の直鎖又
は分枝鎖状アルコキシ基なる群より選ばれた基を1~3
個有することのあるフェノキシ基を例示できる。

置換基を有することのあるフェニル基としては、例え
15 ば、フェニル、2-メチルフェニル、3-メチルフェニ
ル、4-メチルフェニル、2-エチルフェニル、3-プ
ロピルフェニル、4-ブチルフェニル、2-ペンチルフェ
ニル、3-ヘキシルフェニル、3, 4-ジメチルフェ
ニル、3, 4, 5-トリメチルフェニル、2-メトキシ
20 フェニル、3-メトキシフェニル、4-メトキシフェニ
ル、2-エトキシフェニル、4-エトキシフェニル、3
-プロポキシフェニル、4-プロポキシフェニル、4-

ブトキシフェニル、 2-ペンチルオキシフェニル、 3-
ヘキシルオキシフェニル、 2, 4-ジメトキシフェニル、
3, 4-ジエトキシフェニル、 3, 4, 5-トリメトキシ
フェニル、 2-ヒドロキシフェニル、 3-ヒドロキシ
5 フェニル、 4-ヒドロキシフェニル、 2, 4-ジヒドロ
キシフェニル、 3, 4-ジヒドロキシフェニル、 2, 4,
6-トリヒドロキシフェニル、 2-アセチルオキシフェ
ニル、 3-プロピオニルオキシフェニル、 2-ベンジル
オキシフェニル、 3-ベンジルオキシフェニル、 4-ベ
10 ンジルオキシフェニル、 2-(2-フェニルエトキシ)
フェニル、 3-(3-フェニルプロポキシ)フェニル、
4-(4-フェニルブトキシ)フェニル、 3-(1-フェ
ニルエトキシ)フェニル、 2-(5-フェニルペンチ
ルオキシ)フェニル、 3-(6-フェニルヘキシルオキ
15 シ)フェニル、 2, 4-ジベンジルオキシフェニル、 3,
4-ジベンジルオキシフェニル、 3, 4, 5-トリベン
ジルオキシフェニル、 4-ブチルオキシフェニル、 2
-ペンタノイルオキシフェニル、 4-ヘキサノイルオキ
シフェニル、 2, 4-ジアセチルオキシフェニル、 2,
20 6-ジアセチルオキシフェニル、 3, 4, 5-トリアセ
チルオキシフェニル、 2-トリフルオロメトキシフェ
ニル、 3-(2-クロロエトキシ)フェニル、 2-(3-

- ブロモプロポキシ) フェニル、4-ヨードメトキシフェ
ニル、2-(2, 3-ジクロロプロポキシ) フェニル、
3-(4-フルオロブトキシ) フェニル、4-(3-ク
ロロ-2-メチルプロポキシ) フェニル、2-(5-ブ
5 ロモヘキシルオキシ) フェニル、3-(5, 6-ジクロ
ロヘキシルオキシ) フェニル、4-(2, 2, 2-トリ
クロロエトキシ) フェニル、2, 4-ビストリフルオロ
メトキシフェニル、2, 4, 6-トリ(トリフルオロメ
トキシ) フェニル、2-アミノメトキシフェニル、3-
10 (1-アミノエトキシ) フェニル、4-(3-アミノプロ
ポキシ) フェニル、2-(4-アミノブトキシ) フェ
ニル、3-(5-アミノペンチルオキシ) フェニル、4
-(6-アミノヘキシルオキシ) フェニル、2-メチル
アミノメトキシフェニル、3-(2-プロピルアミノエ
15 トキシ) フェニル、2-(3-イソプロピルアミノプロ
ポキシ) フェニル、4-(4-ブチルアミノブトキシ)
フェニル、2-(5-ペンチルアミノペンチルオキシ)
フェニル、3-(6-ヘキシルアミノヘキシルオキシ)
フェニル、4-ジメチルアミノメトキシフェニル、2-
20 (N-エチル-N-プロピルアミノメトキシ) フェニル、
2-メチル-4-メトキシフェニル、2-メチル-6-
ヒドロキシフェニル、4-メチル-2-(3-ブロモブ

ロポキシ) フェニル、4-メトキシ-2-(3-イソプロ
ピルアミノプロポキシ) フェニル、2-フェニルフェ
ニル、3-フェニルフェニル、4-フェニルフェニル、
2-ニトロフェニル、3-ニトロフェニル、4-ニトロ
5 フェニル、2, 3-ジニトロフェニル、2, 4, 6-トリ
ニトロフェニル、2-アミノエチル、3-アミノフェ
ニル、4-アミノフェニル、2, 4-ジアミノフェニル、
3, 4, 5-トリアミノフェニル、4-アセチルアミノ
フェニル、2-プロピオニルアミノフェニル、3-ブチ
10 リルアミノフェニル、4-ペンタノイルアミノフェニル、
4-ヘキサノイルアミノフェニル、2, 3-ジアセチル
アミノフェニル、2, 4, 6-トリアセチルアミノフェ
ニル基等のフェニル環上に置換基として炭素数1~6の
直鎖又は分枝鎖状アルキル基、炭素数1~6の直鎖又は
15 分枝鎖状アルコキシ基、水酸基、炭素数1~6の直鎖又は
分枝鎖状アルカノイルオキシ基、置換基としてハロゲ
ン原子を1~3個有する炭素数1~6の直鎖又は分枝鎖
状アルコキシ基、ニトロ基、置換基として炭素数1~6
の直鎖又は分枝鎖状アルカノイル基を有することのある
20 アミノ基、フェニル基、及び置換基として炭素数1~6
の直鎖又は分枝鎖状アルキル基を1~2個有することの
あるアミノ基を有する炭素数1~6の直鎖又は分枝鎖状

アルコキシ基なる群より選ばれた基を1～3個有することのあるフェニル基を例示できる。

- 置換基を有することのあるピリジルオキシ基としては、
例えば2-ピリジルオキシ、3-ピリジルオキシ、4-
5 ピリジルオキシ、(3-メチル)-2-ピリジルオキシ、
(4-メチル)-2-ピリジルオキシ、(5-メチル)-
2-ピリジルオキシ、(2-メチル)-3-ピリジル
オキシ、(4-メチル)-3-ピリジルオキシ、(5-
メチル)-3-ピリジルオキシ、(2-メチル)-4-
10 ピリジルオキシ、(3-メチル)-4-ピリジルオキシ、
(3-ブチル)-2-ピリジルオキシ、(4-ブチル)-
2-ピリジルオキシ、(5-ブチル)-2-ピリジル
オキシ、(2-ブチル)-3-ピリジルオキシ、(4-
ブチル)-3-ピリジルオキシ、(5-ブチル)-3-
15 ピリジルオキシ、(2-ブチル)-4-ピリジルオキシ、
(3-ブチル)-4-ピリジルオキシ、(3-トリフル
オロメチル)-2-ピリジルオキシ、(4-トリフルオ
ロメチル)-2-ピリジルオキシ、(5-トリフルオロ
メチル)-2-ピリジルオキシ、(2-トリフルオロメ
20 チル)-3-ピリジルオキシ、(4-トリフルオロメチ
ル)-3-ピリジルオキシ、(5-トリフルオロメチル)-
3-ピリジルオキシ、(2-トリフルオロメチル)-

4-ピリジルオキシ、(3-トリフルオロメチル)-4-
 -ピリジルオキシ、(3-トリクロロメチル)-2-ピ
 リジルオキシ、(4-トリクロロメチル)-2-ピリジ
 ルオキシ、(5-トリクロロメチル)-2-ピリジルオ
 キシ、(2-トリクロロメチル)-3-ピリジルオキシ、
 (4-トリクロロメチル)-3-ピリジルオキシ、(5-
 -トリクロロメチル)-3-ピリジルオキシ、(2-トリ
 クロロメチル)-4-ピリジルオキシ、(3-トリク
 ロロメチル)-4-ピリジルオキシ等のピリジン環上

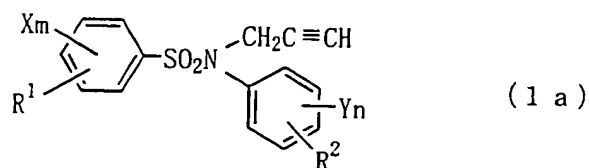
10 に置換基として炭素数1~6の直鎖又は分枝鎖状アルキ
 ル基及びハロゲン原子なる群より選ばれた基を1~3個
 有することのあるピリジルオキシ基を例示できる。

低級アルキルチオ基としては、例えば、メチルチオ、
 エチルチオ、プロピルチオ、イソプロピルチオ、ブチル
 15 チオ、tert-ブチルチオ、ペンチルチオ、ヘキシル
 チオ基等の炭素数1~6の直鎖又は分枝鎖状アルキルチ
 オ基を例示できる。

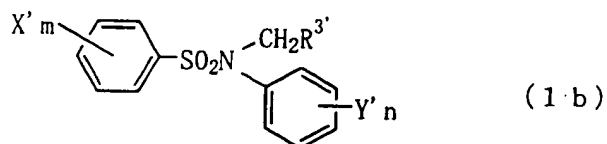
低級アルキルスルホニル基としては、例えばメチルス
 ルホニル、エチルスルホニル、プロピルスルホニル、イ
 0 ソプロピルスルホニル、ブチルスルホニル、tert-
 ブチルスルホニル、ペンチルスルホニル、ヘキシルスル
 ホニル基等の炭素数1~6の直鎖又は分枝鎖状アルキル

スルホニル基を挙げる事ができる。

上記一般式(1)で表されるスルホンアミド誘導体には、下記一般式(1a)で表されるスルホンアミド誘導体及び一般式(1b)で表されるスルホンアミド誘導体が包含される。



10 [式中、 R^1 、 R^2 、 X 、 Y 、 m 及び n は前記に同じ。]



15 [式中、 $R^{3'}$ は、シアノ基、低級アルコキシ基又は低級アルコキシカルボニル基を示す。 X' は水素原子、ハロゲン原子、低級ハロアルキル基又はシアノ基を示す。

Y' は水素原子、ハロゲン原子、低級ハロアルキル基、シアノ基又はニトロ基を示す。 m 及び n は前記に同じ。]

20 上記一般式(1a)で表されるスルホンアミド誘導体の中で代表的なものを以下に示す。

X がハロゲン原子、 Y が低級ハロアルキル基、 R^1 及び

R^2 が水素原子であり、 m が1～3の整数、 n が1又は2である一般式(1a)の化合物

X がハロゲン原子、 Y が低級ハロアルキル基、 R^1 が水素原子、 R^2 がハロゲン原子であり、 m が1～3の整数、
5 n が1又は2である一般式(1a)の化合物

X がシアノ基、 Y が低級ハロアルキル基、 R^1 及び R^2 が水素原子であり、 m が1、 n が1又は2である一般式(1a)の化合物

X がシアノ基、 Y が低級ハロアルキル基、 R^1 が水素原子、 R^2 がハロゲン原子であり、 m が1、 n が1又は2である一般式(1a)の化合物
10

X が低級ハロアルキル基、 Y が低級ハロアルキル基、 R^1 及び R^2 が水素原子であり、 m 及び n が1又は2である一般式(1a)の化合物

15 上記一般式(1b)で表されるスルホンアミド誘導体の中で代表的なものを以下に示す。

X' がハロゲン原子、 Y' が低級ハロアルキル基であり、 m が1～3、 n が1又は2である一般式(1b)の化合物

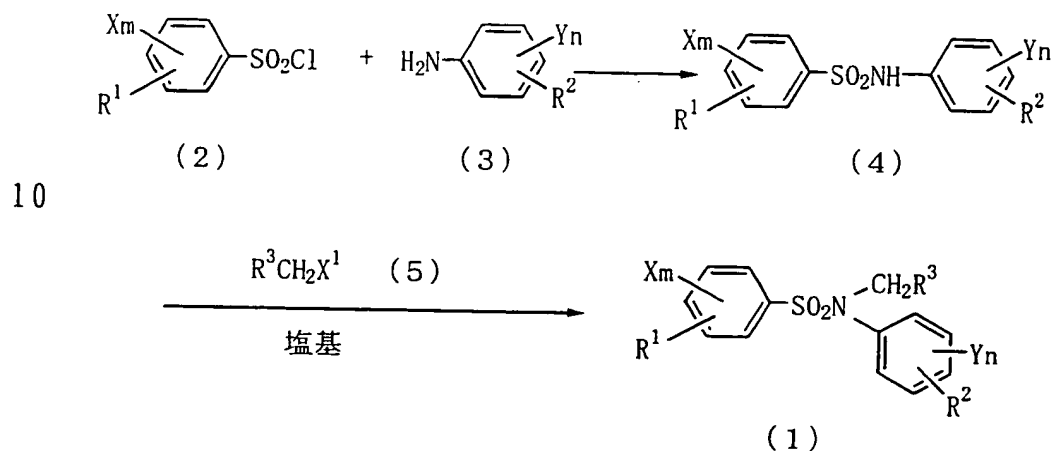
20 X' が低級ハロアルキル基、 Y' が低級ハロアルキル基であり、 m 及び n が1又は2である一般式(1b)の化合物

$R^{3'}$ がシアノ基である一般式 (1b) の化合物

$R^{3'}$ が低級アルコキシ基である一般式 (1b) の化合物

本発明のスルホンアミド誘導体は、例えば下記反応式
5 - 1 に示す方法により製造される。

反応式 - 1



15 [式中、 R^1 、 R^2 、 R^3 、X、Y、m、n は前記に同じ。
 X^1 はハロゲン原子を示す。]

即ち、上記反応式 - 1 によれば一般式 (1) で表される本発明の化合物は、一般式 (2) で表わされるスルホン
 ニルクロリド類と一般式 (3) で表わされるアニリン類
 20 とを反応させ、次いで得られる一般式 (4) のスルホン
 アミド類に一般式 (5) で表わされるハロゲン化物を塩
 基の存在下に反応させることにより製造される。

- 一般式(2)のスルホニルクロリド類と一般式(3)のアニリン類との反応は、特開平4-145060号公報に記載の方法に準じて行われる。即ち、一般式(2)のスルホニルクロリド類と一般式(3)のアニリン類との使用割合としては、通常前者1モルに対して後者を0.5~2モル、好ましくは0.7~1.3モルとするのがよい。この反応は、通常有機溶媒中で行われる。有機溶媒としては、従来公知のものを広く使用することができ、例えばベンゼン、トルエン、キシレン等の芳香族炭化水素類、ジクロロメタン、クロロホルム、四塩化炭素等のハロゲン化炭化水素類等やこれらの混合溶媒を挙げることができる。この反応は、 β -ピコリン、 γ -ピコリン等の塩基性化合物の存在下で行うのが有利である。塩基性化合物の使用量は、一般式(2)のスルホニルクロリド類1モル当たり、通常0.01~1モル、好ましくは0.1~0.5モルとするのがよい。上記反応は、通常130~200℃、好ましくは140~180℃で好適に進行し、一般に3~15時間程度で反応は完結する。
- 一般式(4)のスルホンアミド類と一般式(5)のハロゲン化物との反応は、通常、塩基の存在下、適当な溶媒中で行うことができる。使用される溶媒としては、例

例えばジエチルエーテル、テトラヒドロフラン等のエーテル類、アセトニトリル、プロピオニトリル等のニトリル類、アセトン、メチルエチルケトン等のケトン類、メタノール、エタノール等のアルコール類、ジメチルホルムアミド、ジメチルアセトアミド等のアミド類又はこれらの混合溶媒等が例示できる。また使用される塩基としては、例えば炭酸ナトリウム、炭酸カリウム等のアルカリ金属炭酸塩無水物、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム等のアルカリ金属水酸化物、水素化ナトリウム、水素化カリウム等のアルカリ金属水素化物等が例示できる。これら塩基は1種単独で又は2種以上混合して使用される。斯かる塩基の量としては、一般式(4)のスルホンアミド類に対して通常等モル～5倍モル程度、好ましくは等モル～2倍モル程度とするのがよい。一般式(4)のスルホンアミド類と一般式(5)のハロゲン化物との使用割合は、通常前者に対して後者を0.5～2倍モル程度、好ましくは1～1.2倍モル程度とするのがよい。該反応は、通常、0℃から使用する溶媒の沸点温度にて良好に進行し、一般に1～8時間程度で終了する。上記反応において、出発原料として使用される一般式(5)のハロゲン化物は、市販物をそのまま使用できる。

上記の方法で得られる一般式(1)の本発明化合物は、

通常の分離手段、例えば溶媒抽出法、再結晶法、カラムクロマトグラフィー法等の慣用の単離精製手段により反応混合物から容易に単離、精製される。

上記反応式 - 1 に示した製造法に従えば、本発明化合物は高収率、且つ高純度で製造され得る。

本発明化合物は広く農業上問題となる各種害虫に対して有効に作用するが、特に有効に作用する害虫としては、例えば、ハスモンヨトウ、コナガ等の鱗翅目類、モモアカアブラムシ、ヒメトビウンカ等の半翅目類、ナミハダニ、ミカンハダニ等のハダニ類、サツマイモネコブセンチュウ等の線虫類等を例示できる。

本発明化合物を殺虫剤、殺ダニ剤及び殺線虫剤として使用する場合、乳剤、水和剤、水溶剤、粒剤、微粒剤、顆粒剤、粉剤、塗布剤、スプレー用製剤、エアゾール製剤、マイクロカプセル製剤、薫蒸用製剤、薫煙用製剤等の形態で用いることができる。これら製剤を調製するに当たっては乳化、分散、懸濁、発泡させるために各種界面活性剤を用いることができる。界面活性剤の具体例としては、例えば非イオン界面活性剤としてはポリオキシエチレンアルキルエーテル、ポリオキシエチレンアルキルエステル、ポリオキシエチレンソルビタンアルキルエステル等を、陰イオン界面活性剤としてはアルキルベン

ゼンスルホネート、アルキルスルホサクシネート、アルキルサルフェート、ポリオキシエチレンアルキルサルフェート、アリルスルフォネート、リグニン亜硫酸塩等を例示できる。また溶剤、希釈剤、担体としては、各種有機溶媒、各種エアゾール噴射剤、各種天然鉱物並びに各種合成化合物等を用いることができる。有機溶媒としては、例、ベンゼン、トルエン、キシレン、エチルベンゼン、クロルベンゼン、アルキルナフタリン、クロルエレン、シクロヘキサノン、メチルエチルケトン、メチルイソブチルケトン、アルコール類、セロソルブ類、ジメチルホルムアミド、ジメチルスルホキシド、アセトニトリル、鉱油留分及び水等を好ましく用いることができる。エアゾール噴射剤としては、例えばプロパン、ブタン、ハロゲン化炭化水素、チッ素、二酸化炭素等を例示できる。これら製剤は有機乃至無機染料を用いて着色してもよい。

本発明において上記各種製剤を製造するに当たり本発明の化合物を約 0.1 ~ 95 重量%、好ましくは約 0.5 ~ 90 重量%を含有するように製剤することができる。

上記で調製された製剤はそのままあるいは担体もしくは水で希釈して用いられるが目的に応じて約

0. 0 0 0 1 ~ 1 0 0 重量%の範囲で自由に希釈することができ、好ましくは0. 0 0 1 ~ 1 0 重量%の活性成分を含有するように希釈して使用するのがよい。

発明を実施するための最良の形態

- 5 以下に原料化合物の製造例を参考例として、本発明化合物の製造例を実施例として掲げ、更に試験例を挙げて本発明をより一層明らかにする。

参考例 1

- 3, 5 - ジクロロ - N - (4 - トリフルオロメチルフェ
10 ニル) ベンゼンスルホンアミドの製造

- p - アミノベンゾトリフルオライド (1. 6 1 g,
0. 0 1 モル) 及びピリジン (0. 8 g, 0. 0 1 1 モ
ル) のトルエン (4 5 m l) の溶液中へ、攪拌下に 3,
5 - ジクロロフェニルベンゼンスルホニルクロリド
15 (2. 4 6 g, 0. 0 1 モル) のトルエン (5 m l) 溶
液を 1 0 ° C 以下で滴下し、滴下後、反応混合物を室温で
1 6 時間攪拌した。次に酢酸エチル (1 0 0 m l) を注
加した後、5 % 塩酸、次いで 5 % 炭酸水素ナトリウム、
最後に食塩水で洗浄後無水硫酸マグネシウム上で乾燥し
20 た。溶媒を留去し、残留した固形物を n - ヘキサンで洗
浄し、吸引濾過後乾燥して白色結晶として上記目的物
(3. 2 g, 8 5. 8 %) を得た。

参考例 2

2, 4, 5-トリクロロ-N-(4-トリフルオロメチルフェニル)ベンゼンスルホンアミドの製造

p-アミノベンゾトリフルオライド (1.61 g、
5 0.01 モル) 及びピリジン (0.8 g、0.011 モル) のトルエン (45 ml) の溶液中へ、攪拌下 2, 4, 5-トリクロロフェニルベンゼンスルホンクロリド (2.82 g、0.01 モル) のトルエン (5 ml) 溶液を 10℃以下で滴下し、滴下後、反応混合物を室温で
10 16 時間攪拌した。次に酢酸エチル (100 ml) を加え、その後 5% 塩酸水溶液、次いで 5% 炭酸水素ナトリウム水溶液、最後に食塩水で洗浄した後無水硫酸マグネシウム上で乾燥した。溶媒を留去し、残留した固形物を n-ヘキサンで洗浄し、吸引濾過後乾燥して白色結晶と
15 して上記目的物を 73% の収率で得た。

実施例 1

N-プロパルギル-3, 5-ジクロロ-N-(4-トリフルオロメチルフェニル)ベンゼンスルホンアミドの製造

20 3, 5-ジクロロ-N-(4-トリフルオロメチルフェニル)ベンゼンスルホンアミド (2.22 g、0.006 モル) を 60% 水素化ナトリウム (0.27

g、0.006モル)のジメチルホルムアミド(15 ml)懸濁溶液中へ10℃以下で少量ずつ添加した。全量添加後、室温で30分間攪拌した後、プロパルギルブロミド(1.18g、0.01モル)の無水ベンゼン
5 (5ml)溶液を滴下し、滴下後反応混合物を室温で更に6時間攪拌した。次に反応系内へ冷水を注ぎ込み、油層をベンゼン抽出し、抽出液を食塩水で洗浄後無水硫酸マグネシウム上で乾燥した。溶媒を留去した残留物をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(n-ヘキサン:酢酸
10 エチル = 5 : 1)で精製し、黄色油状物として目的物(2.1g、85.4%)を得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm; 2.30 (1H, t), 4.48 (2H, d), 7.20 - 7.78 (7H, m)

15 適当な出発原料を用い、実施例1と同様にして下記実施例2～実施例45の化合物を得た。

実施例2

R^1 及び R^2 が水素原子、Xが水素原子、Yがトリフルオロメチル基(4位)である一般式(1a)の化合物:

20 黄色油状

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm; 2.14 (1H, t), 4.36 (2H, d), 6.96 - 7.78 (9

H, m)

実施例 3

R¹及びR²が水素原子、Xが水素原子、Yが塩素原子
(4位)である一般式(1a)の化合物:

5 融点 81 - 82 °C

¹H-NMR (CDCl₃) δ ppm; 2. 18 (1 H, t), 4. 42 (2 H, d,), 7. 20 - 7. 80 (9 H, m)

実施例 4

10 R¹及びR²が水素原子、Xが水素原子、Yが塩素原子
(3位及び5位)である一般式(1a)の化合物:

融点 99 - 101 °C

¹H-NMR (CDCl₃) δ ppm; 2. 24 (1 H, t), 4. 42 (2 H, d), 6. 82 - 7. 90

15 (8 H, m)

実施例 5

R¹及びR²が水素原子、Xが水素原子、Yが弗素原子
(4位)である一般式(1a)の化合物:

黄色油状

20 ¹H-NMR (CDCl₃) δ ppm; 2. 20 (1 H, t), 4. 42 (2 H, d), 6. 78 - 7. 86 (9 H, m)

実施例 6

R^1 及び R^2 が水素原子、 X が水素原子、 Y がニトロ基
(4 位) である一般式 (1 a) の化合物 :

黄色油状

5 ^1H-NMR ($CDCl_3$) δ ppm ; 2. 24 (1 H, t), 4. 52 (2 H, d), 7. 24 - 8. 32 (9 H, m)

実施例 7

R^1 が水素原子、 R^2 が塩素原子 (2 位)、 X が水素原子、
10 Y がニトロ基 (4 位) である一般式 (1 a) の化合物 :

黄色油状

^1H-NMR ($CDCl_3$) δ ppm ; 2. 26 (1 H, t), 4. 48 (2 H, d), 7. 20 - 8. 38 (8 H, m)

15 実施例 8

R^1 及び R^2 が水素原子、 X が塩素原子 (4 位)、 Y がトリフルオロメチル基 (4 位) である一般式 (1 a) の化合物 :

融点 67 - 68 °C

20 ^1H-NMR ($CDCl_3$) δ ppm ; 2. 24 (1 H, t), 4. 48 (2 H, d), 7. 22 - 7. 78 (8 H, m)

実施例 9

R¹及びR²が水素原子、Xが塩素原子（3位）、Yがトリフルオロメチル基（4位）である一般式（1a）の化合物：

5 黄色油状

¹H-NMR (CDCl₃) δ ppm ; 2. 30 (1 H, t), 4. 48 (2 H, d), 7. 02 - 7. 82 (8 H, m)

実施例 10

10 R¹及びR²が水素原子、Xがメトキシ基（4位）、Yがトリフルオロメチル基（4位）である一般式（1a）の化合物：

黄色油状

15 ¹H-NMR (CDCl₃) δ ppm ; 2. 22 (1 H, t), 3. 80 (3 H, s), 4. 48 (2 H, d), 7. 02 - 7. 82 (8 H, m)

実施例 11

20 R¹及びR²が水素原子、Xがシアノ基（4位）、Yがトリフルオロメチル基（4位）である一般式（1a）の化合物：

融点 108 - 110 °C

¹H-NMR (CDCl₃) δ ppm ; 2. 26 (1 H,

t), 4.48 (2H, d), 7.24 - 7.76
(8H, m)

実施例 1 2

R¹及びR²が水素原子、Xがtert-ブチル基(4位)、
5 Yがトリフルオロメチル基(4位)である一般式(1a)
の化合物:

黄色油状

¹H-NMR (CDCl₃) δ ppm; 1.30 (9H,
s), 2.26 (1H, t), 4.48 (2H, d),
10 7.24 - 7.76 (8H, m)

実施例 1 3

R¹及びR²が水素原子、Xがニトロ基(4位)、Yがト
リフルオロメチル基(4位)である一般式(1a)の化
合物:

15 黄色油状

¹H-NMR (CDCl₃) δ ppm; 2.26 (1H,
t), 4.52 (2H, d), 7.26 - 8.48
(8H, m)

実施例 1 4

20 R¹及びR²が水素原子、Xが塩素原子(3位及び4位)、
Yがトリフルオロメチル基(4位)である一般式(1a)
の化合物:

融点 97 - 99 °C

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm ; 2. 28 (1 H, t), 4. 48 (2 H, d), 7. 20 - 7. 90 (7 H, m)

5 実施例 15

R^1 及 R^2 が水素原子、X が塩素原子 (2 位、4 位及び 5 位)、Y がトリフルオロメチル基 (4 位) である一般式 (1 a) の化合物 :

黄色油状

10 $^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm ; 2. 30 (1 H, t), 4. 58 (2 H, d), 7. 38 - 7. 78 (5 H, m), 8. 0 (1 H, s)

実施例 16

R^1 及び R^2 が水素原子、X が塩素原子 (3 位及び 5 位)、
15 Y がニトロ基 (4 位) である一般式 (1 a) の化合物 :

融点 96 - 97 °C

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm ; 2. 32 (1 H, t), 4. 50 (2 H, d), 7. 38 - 8. 32 (7 H, m)

20 実施例 17

R^1 が水素原子、 R^2 が弗素原子 (4 位)、X が塩素原子 (3 位及び 5 位)、Y がニトロ基 (3 位) である一般式

(1 a) の化合物 :

融点 94 - 95 °C

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm ; 2. 26 (1 H, t), 4. 50 (2 H, d), 7. 12 - 7. 96
5 (6 H, m)

実施例 18

R^1 が水素原子、 R^2 が塩素原子 (4 位)、 X が塩素原子 (3 位及び 5 位)、 Y がトリフルオロメチル基 (3 位) である一般式 (1 a) の化合物 :

10 黄色油状

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm ; 2. 33 (1 H, t), 4. 48 (2 H, d), 7. 26 - 7. 80
(6 H, m)

実施例 19

15 R^1 及び R^2 が水素原子、 X が塩素原子 (3 位及び 5 位)、 Y がトリフルオロメチル基 (3 位) である一般式 (1 a) の化合物 :

黄色油状

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm ; 2. 34 (1 H, t), 4. 48 (2 H, d), 7. 20 - 7. 80
20 (7 H, m)

実施例 20

R¹及びR²が水素原子、Xが塩素原子（3位及び5位）、
Yが弗素原子（3位及び4位）である一般式（1a）の
化合物：

融点 97 - 98 °C

5 ¹H - NMR (CDCl₃) δ ppm ; 2. 32 (1 H,
t), 4. 42 (2 H, d), 6. 92 - 7. 62
(6 H, m)

実施例 2 1

R¹及びR²が水素原子、Xが塩素原子（3位及び5位）、
10 Yが弗素原子（2位及び4位）である一般式（1a）の
化合物：

融点 81 - 82 °C

¹H - NMR (CDCl₃) δ ppm ; 2. 28 (1 H,
t), 4. 40 (2 H, d), 6. 62 - 7. 22
15 (6 H, m)

実施例 2 2

R¹及びR²が水素原子、Xが塩素原子（3位及び5位）、
Yがトリフルオロメトキシ基（4位）である一般式
(1a) の化合物：

20 融点 87 - 89 °C

¹H - NMR (CDCl₃) δ ppm ; 2. 32 (1 H,
t), 4. 48 (2 H, d), 7. 06 - 7. 70

(7 H, m)

実施例 2 3

R¹及びR²が水素原子、Xが塩素原子（2位、4位及び5位）、Yがトリフルオロメチル基（3位）である一般式（1a）の化合物：

黄色油状

¹H-NMR (CDCl₃) δ ppm ; 2. 32 (1 H, t), 4. 62 (2 H, d), 7. 20 - 8. 22 (6 H, m)

10 実施例 2 4

R¹が水素原子、R²が塩素原子（4位）、Xが塩素原子（2位、4位及び5位）、Yがトリフルオロメチル基（3位）である一般式（1a）の化合物：

黄色油状

15 ¹H-NMR (CDCl₃) δ ppm ; 2. 30 (1 H, t), 4. 52 (2 H, d), 7. 38 - 8. 10 (5 H, m)

実施例 2 5

20 R¹及びR²が水素原子、Xが塩素原子（2位、4位及び5位）、Yが弗素原子（2位及び4位）である一般式（1a）の化合物：

融点 72 - 73 °C

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm; 2.34 (1 H, t), 4.62 (2 H, d), 6.62 – 8.04 (5 H, m)

実施例 26

- 5 R^1 及び R^2 が水素原子、X が塩素原子 (2 位、4 位及び 5 位)、Y が弗素原子 (3 位及び 4 位) である一般式 (1a) の化合物:

融点 83 – 84 °C

10 $^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm; 2.30 (1 H, t), 4.52 (2 H, d), 6.80 – 8.06 (5 H, m)

実施例 27

- R^1 及び R^2 が水素原子、X が塩素原子 (2 位、4 位及び 5 位)、Y がトリフルオロメチル基 (3 位及び 5 位) である一般式 (1a) の化合物:

融点 99 – 100 °C

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm; 2.40 (1 H, t), 4.60 (2 H, d), 6.40 – 8.26 (5 H, m)

20 実施例 28

- R^1 及び R^2 が水素原子、X が塩素原子 (3 位及び 4 位)、Y がトリフルオロメチル基 (3 位) である一般式 (1a)

の化合物：

黄色油状

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm ; 2. 26 (1 H, t), 4. 46 (2 H, d), 7. 26 - 7. 90
5 (7 H, m)

実施例 29

R^1 が水素原子、 R^2 が塩素原子(4位)、 X が塩素原子(3位及び4位)、 Y がトリフルオロメチル基(3位)である 式(1a)の化合物：

10 融点 112 - 114 $^{\circ}\text{C}$

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm ; 2. 30 (1 H, t), 4. 44 (2 H, d), 7. 28 - 7. 90
(6 H, m)

実施例 30

15 R^1 及び R^2 が水素原子、 X が塩素原子(3位及び4位)、 Y が弗素原子(2位及び4位)である一般式(1a)の化合物：

融点 90 - 91 $^{\circ}\text{C}$

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm ; 2. 28 (1 H, t), 4. 42 (2 H, d), 6. 68 - 7. 96
20 (6 H, m)

実施例 31

R¹及びR²が水素原子、Xが塩素原子（3位及び4位）、
Yがトリフルオロメトキシ基（4位）である一般式
(1a)の化合物：

融点 101 - 102 °C

5 ¹H-NMR (CDCl₃) δ ppm ; 2. 24 (1 H,
t), 4. 40 (2 H, d), 7. 06 - 7. 78
(7 H, m)

実施例 3 2

R¹が水素原子、R²が弗素原子（4位）、Xが塩素原子
10 (3位、4位及び5位)、Yがニトロ基（3位）である
一般式 (1a) の化合物：

融点 118 - 119 °C

¹H-NMR (CDCl₃) δ ppm ; 2. 32 (1 H,
t), 4. 56 (2 H, d), 7. 06 - 8. 14
15 (5 H, m)

実施例 3 3

R¹及びR²が水素原子、Xが塩素原子（2位及び5位）、
Yがトリフルオロメチル基（4位）である一般式 (1a)
の化合物：

20 黄色油状

¹H-NMR (CDCl₃) δ ppm ; 2. 30 (1 H,
t), 4. 62 (2 H, d), 7. 22 - 8. 02

(7 H, m)

実施例 3 4

R¹及びR²が水素原子、Xがトリフルオロメチル基(3位)、Yがトリフルオロメチル基(4位)である一般式
5 (1 a) の化合物 :

黄色油状

¹H-NMR (CDCl₃) δ ppm ; 2. 23 (1 H, t), 4. 48 (2 H, d), 7. 20 - 8. 10
(8 H, m)

10 実施例 3 5

R¹及びR²が水素原子、Xがトリフルオロメチル基(3位及び5位)、Yがトリフルオロメチル基(4位)である一般式(1 a) の化合物 :

融点 128 - 130 °C

15 ¹H-NMR (CDCl₃) δ ppm ; 2. 42 (1 H, t), 4. 56 (2 H, d), 7. 10 - 8. 40
(8 H, m)

実施例 3 6

R¹及びR²が水素原子、Xが弗素原子(4位)、Yがトリフルオロメチル基(4位)である一般式(1 a) の化合物 :

20 融点 57 - 58 °C

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm; 2. 22 (1 H, t), 4. 48 (2 H, d), 6. 94 - 7. 90 (8 H, m)

実施例 37

- 5 R^1 及び R^2 が水素原子、X が弗素原子 (4 位)、Y が弗素原子 (2 位 及び 6 位) である一般式 (1 a) の化合物

黄色油状

10 $^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm; 2. 18 (1 H, t), 4. 36 (2 H, d), 6. 70 - 8. 10 (6 H, m)

実施例 38

- R^1 及び R^2 が水素原子、X がシアノ基 (4 位)、Y がトリフルオロメチル基 (3 位) である一般式 (1 a) の化合物
- 15 化合物:

融点 103 - 104 °C

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm; 2. 30 (1 H, t), 4. 50 (2 H, d), 7. 30 - 7. 88 (4 H, m)

20 実施例 39

- R^1 が水素原子、 R^2 が塩素原子 (4 位)、X がシアノ基 (4 位)、Y がトリフルオロメチル基 (3 位) である一般

式 (1 a) の化合物 :

融点 135 - 137 °C

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm ; 2. 32 (1 H, t), 4. 48 (2 H, d), 7. 38 - 7. 68
5 (3 H, m), 7. 78 (4 H, s)

実施例 40

R^1 及び R^2 が水素原子、X がシアノ基 (4 位)、Y が弗素原子 (3 位及び 4 位) である一般式 (1 a) の化合物 :

10 融点 116 - 118 °C

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm ; 2. 26 (1 H, t), 4. 46 (2 H, d), 6. 98 - 7. 80
(6 H, m)

実施例 41

15 R^1 及び R^2 が水素原子、X が塩素原子 (3 位及び 5 位)、Y が (4 - トリフルオロメチル) - 2 - ピリジルオキシ基 (4 位) である一般式 (1 a) の化合物 :

融点 108 - 111 °C

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm ; 2. 20 (1 H, t), 4. 42 (2 H, d), 6. 90 - 7. 95
20 (9 H, m), 8. 35 (1 H, bs)

実施例 42

R¹及びR²が水素原子、Xが塩素原子（3位及び4位）、
Yが（4-トリフルオロメチル）-2-ピリジルオキシ
基（4位）である一般式（1a）の化合物：

融点 140 - 141 °C

- 5 ¹H-NMR (CDCl₃) δ ppm ; 2. 32 (1 H, t), 4. 42 (2 H, d), 7. 00 - 8. 10 (9 H, m)、8. 40 (1 H, bs)

実施例 43

- R¹がトリフルオロメチル基（3位）、R²が水素原子、
10 Xが塩素原子（4位）、Yがトリフルオロメチル基（3位及び5位）である一般式（1a）の化合物：

黄色油状

- ¹H-NMR (CDCl₃) δ ppm ; 2. 30 (1 H, t), 4. 48 (2 H, d), 7. 02 - 7. 82
15 (7 H, m)

実施例 44

- R¹及びR²が水素原子、Xがトリフルオロメチル基（3位及び5位）、Yがトリフルオロメチル基（3位及び5位）である一般式（1a）の化合物：

- 20 黄色油状

- ¹H-NMR (CDCl₃) δ ppm ; 2. 28 (1 H, t), 4. 46 (2 H, d), 7. 02 - 7. 92

(7 H, m)

実施例 4 5

R¹及びR²が水素原子、Xが塩素原子（3位及び5位）、
Yがトリフルオロメチル基（3位及び5位）である一般
5 式（1 a）の化合物：

黄色油状

¹H-NMR (CDCl₃) δ ppm ; 2. 3 0 (1 H, t), 4. 4 3 (2 H, d), 6. 9 8 - 7. 8 8 (7 H, m)

10 実施例 4 6

N-シアノメチル-2, 4, 5-トリクロロ-N-(4-トリフルオロメチルフェニル)ベンゼンスルホンアミ
ドの製造

2, 4, 5-トリクロロ-N-(4-トリフルオロメ
15 チルフェニル)ベンゼンスルホンアミド（2. 3 5 g、
0. 0 0 6 モル）を、60%水素化ナトリウム
（0. 2 7 g、0. 0 0 6 モル）のジメチルホルムアミ
ド（1 5 m l）懸濁溶液中へ1 0℃以下で少量ずつ添加
した。全量添加後、室温で3 0分攪拌した後ブromoアセ
20 トニトリル（1. 2 0 g、0. 0 1 モル）の無水ベンゼ
ン（5 m l）溶液を滴下し、滴下後反応混合物を室温で
更に5時間かき混ぜた。次に系内へ冷水を注ぎ込み、油

層をベンゼン抽出し、抽出液を食塩水で洗浄後無水硫酸
マグネシウム上で乾燥した。溶媒を留去して得た残留物
をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（ベンゼン：酢
酸エチル＝20：1）で精製し、淡黄色油状物として目
5 的物（3.02 g、70%）を得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm; 4.90 (2H),
7.62 – 8.02 (6H)

適当な出発原料を用い、実施例46と同様な方法にし
て下記実施例47～65の化合物を得た。

10 実施例47

$\text{R}^{3'}$ がエトキシ基、 X' が塩素原子（3位及び5位）、
 Y' が弗素原子（3位及び4位）である一般式（1b）
の化合物：

黄色油状

15 $^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm; 1.22 (3H),
3.52 (2H), 4.96 (2H), 6.92 –
7.70 (6H)

実施例48

$\text{R}^{3'}$ がエトキシ基、 X' が塩素原子（3位及び4位）、
20 Y' がトリフルオロメチル基（3位及び5位）である一
般式（1b）の化合物：

黄色油状

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm; 1. 22 (3H),
3. 58 (2H), 5. 04 (2H), 7. 38 -
8. 10 (6H)

実施例 49

5 $\text{R}^{3'}$ がエトキシ基、 X' が塩素原子 (3位及び4位)、
 Y' が塩素原子 (4位) 及びトリフルオロメチル基 (5
位) である一般式 (1b) の化合物:

黄色油状

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm; 1. 22 (3H),
10 3. 58 (2H), 5. 04 (2H), 7. 28 -
7. 90 (6H)

実施例 50

$\text{R}^{3'}$ がエトキシ基、 X' が塩素原子 (2位、4位及び
5位)、 Y' が弗素原子 (3位及び4位) である一般式
15 (1b) の化合物:

黄色油状

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm; 1. 22 (3H),
3. 62 (2H), 5. 14 (2H), 6. 82 -
7. 96 (5H)

20 実施例 51

$\text{R}^{3'}$ がエトキシ基、 X' がシアノ基 (4位)、 Y' が
トリフルオロメチル基 (3位及び5位) である一般式

(1 b) の化合物 :

黄色油状

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm ; 1. 20 (3 H),
3. 52 (2 H), 5. 02 (2 H), 7. 20 -
5 7. 98 (7 H)

実施例 5 2

$\text{R}^{3'}$ がエトキシ基、 X' が塩素原子 (2 位、4 位及び
5 位)、 Y' がトリフルオロメチル基 (3 位及び 5 位)
である一般式 (1 b) の化合物 :

10 黄色油状

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm ; 1. 24 (3 H),
3. 68 (2 H), 5. 20 (2 H), 7. 60 -
8. 08 (5 H)

実施例 5 3

15 $\text{R}^{3'}$ がメトキシ基、 X' がトリフルオロメチル基 (3
位及び 5 位)、 Y' がトリフルオロメチル基 (4 位) で
ある一般式 (1 b) の化合物 :

黄色油状

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm ; 3. 42 (3 H),
20 4. 96 (2 H), 7. 02 - 8. 46 (7 H)

実施例 5 4

$\text{R}^{3'}$ がエトキシ基、 X' がトリフルオロメチル基 (3

位及び5位)、Y'がトリフルオロメチル基(4位)である一般式(1b)の化合物:

黄色油状

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm; 1.20 (3H),
5 3.62 (2H), 5.20 (2H), 7.02 -
8.42 (7H)

実施例 55

$\text{R}^{3'}$ がシアノ基、 X' が塩素原子(3位及び5位)、
Y'が塩素原子(4位)及びトリフルオロメチル基(5
10 位)である一般式(1b)の化合物:

融点 113 - 115 °C

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm; 4.76 (2H),
7.32 - 7.90 (6H)

実施例 56

15 $\text{R}^{3'}$ がシアノ基、 X' が塩素原子(2位、4位及び5
位)、Y'がトリフルオロメチル基(3位及び5位)で
ある一般式(1b)の化合物:

融点 117 - 119 °C

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm; 4.90 (2H),
20 7.42 - 8.26 (5H)

実施例 57

$\text{R}^{3'}$ がシアノ基、 X' がトリフルオロメチル基(3位

及び5位)、Y'がトリフルオロメチル基(4位)である一般式(1b)の化合物:

融点 124 - 126 °C

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl₃) δ ppm; 4.90 (2H),
5 7.02 - 8.10 (7H)

実施例 58

R^{3'}がシアノ基、X'がトリフルオロメチル基(3位及び5位)、Y'がシアノ基(4位)である一般式(1b)の化合物:

10 黄色糊状

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl₃) δ ppm; 4.92 (2H),
6.98 - 8.12 (7H)

実施例 59

R^{3'}がシアノ基、X'がトリフルオロメチル基(3位
15 及び5位)、Y'がニトロ基(4位)である一般式(1b)の化合物:

黄色糊状

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl₃) δ ppm; 4.92 (2H),
7.04 - 8.26 (6H)

20 実施例 60

R^{3'}がシアノ基、X'がトリフルオロメチル基(3位及び5位)、Y'がトリフルオロメチル基(3位及び5

位)である一般式(1b)の化合物:

黄色油状

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm; 4.90 (3H),
7.20 – 8.42 (6H)

5 実施例 6 1

$\text{R}^{3'}$ がシアノ基、 X' がトリフルオロメチル基(4位)、
 Y' が塩素原子(2位)及びニトロ基(4位)である一般式(1b)の化合物:

黄色糊状

10 $^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm; 4.90 (2H),
7.22 – 8.38 (7H)

実施例 6 2

$\text{R}^{3'}$ がシアノ基、 X' がトリフルオロメチル基(4位)、
 Y' がトリフルオロメチル基(4位)である一般式

15 (1b)の化合物:

黄色油状

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm; 4.90 (2H),
7.28 – 8.43 (8H)

実施例 6 3

20 $\text{R}^{3'}$ がエトキシカルボニル基、 X' が塩素原子(2位、
4位及び5位)、 Y' がトリフルオロメチル基(3位及
び5位)である一般式(1b)の化合物:

黄色糊状

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm; 1. 20 (3H),
4. 10 (2H), 4. 50 (2H), 7. 60 -
8. 06 (5H)

5 実施例 6 4

$\text{R}^{3'}$ がエトキシカルボニル基、 X' がトリフルオロメ
チル基 (3 位及び 5 位)、 Y' がトリフルオロメチル基
(4 位) である一般式 (1 b) の化合物:

黄色油状

10 $^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm; 1. 22 (3H),
4. 10 (2H), 4. 52 (2H), 7. 04 -
8. 40 (7H)

実施例 6 5

15 $\text{R}^{3'}$ がメトキシカルボニル基、 X' がトリフルオロメ
チル基 (3 位及び 5 位)、 Y' がトリフルオロメチル基
(4 位) である一般式 (1 b) の化合物:

黄色油状

20 $^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm; 3. 98 (3H),
4. 52 (2H), 7. 02 - 8. 40 (7H)

試験例 1 (ナミハダニに対する試験)

本発明化合物 2 重量部をアセトン 98 重量部に溶解し
た。これを 0. 04 % 展着剤 (日本農薬新リノー) 入り水

溶液を用いて所定の濃度に希釈して溶液を調製した。ポット植えインゲンにナミハダニ成虫を接種し、次いで上記で調製された溶液をしずくがたれ落ちるまで噴霧した。4日後の死去率を測定し、その結果を第1表に示す。第1表における供試化合物No. は実施例番号に対応する。後記第2表及び第3表においても同じである。

第 1 表

供試化合物		供試化合物の濃度 (ppm)	死虫率 (%)
10	1	400	100
	2	400	98
	3	400	100
	4	400	100
	5	400	100
	6	400	95
	7	400	100
	8	400	100
	9	400	100
15	10	400	100
	11	400	100
	12	400	100
	13	400	100
	14	400	100
	15	400	100
	16	400	100
	17	400	100
	18	400	100
20	19	400	100
	20	400	95
	21	400	100

第 1 表 (続き)

	供試化合物	供試化合物の濃度 (p p m)	死虫率 (%)
5	2 2	4 0 0	9 8
	2 3	4 0 0	1 0 0
	2 4	4 0 0	1 0 0
	2 5	4 0 0	9 5
	2 6	4 0 0	1 0 0
	2 7	4 0 0	1 0 0
	2 8	4 0 0	1 0 0
	2 9	4 0 0	1 0 0
	3 0	4 0 0	9 5
	3 1	4 0 0	1 0 0
10	3 2	4 0 0	1 0 0
	3 3	4 0 0	1 0 0
	3 4	4 0 0	1 0 0
	3 5	4 0 0	1 0 0
	3 6	4 0 0	1 0 0
	3 7	4 0 0	1 0 0
	3 8	4 0 0	1 0 0
	3 9	4 0 0	1 0 0
	4 0	4 0 0	1 0 0
	4 1	4 0 0	1 0 0
15	4 2	4 0 0	1 0 0
	4 3	4 0 0	1 0 0
	4 4	4 0 0	1 0 0
	4 5	4 0 0	1 0 0
	4 6	4 0 0	1 0 0
	4 7	4 0 0	1 0 0
	4 8	4 0 0	1 0 0
	4 9	4 0 0	1 0 0
	5 0	4 0 0	1 0 0
	5 1	4 0 0	1 0 0

第 1 表 (続き)

	供試化合物	供試化合物の濃度 (ppm)	死虫率 (%)
5	5 2	4 0 0	1 0 0
	5 3	4 0 0	1 0 0
	5 4	4 0 0	1 0 0
	5 5	4 0 0	1 0 0
	5 6	4 0 0	1 0 0
	5 7	4 0 0	9 0
	5 8	4 0 0	1 0 0
	5 9	4 0 0	1 0 0
	6 0	4 0 0	1 0 0
	6 1	4 0 0	1 0 0
10	6 2	4 0 0	1 0 0
	6 3	4 0 0	1 0 0
	6 4	4 0 0	9 0
	6 5	4 0 0	1 0 0

試験例 2 (コナガに対する試験)

本発明化合物 2 重量部をアセトン 9 8 重量部に溶解し
 た。これを 0. 0 4 % 展着剤 (日本農薬新リノー) 入り水
 溶液を用いて所定の濃度に希釈して溶液を調製した。 7
 cm × 7 cm のキャベツ葉片を上記で調製された溶液に
 1 0 秒間浸漬した。直径 1 3 cm のプラスチック製カッ
 プに上記で処理した葉片と共にコナガ 4 齢幼虫を入れ、
 2 5 ± 1 °C の恒温室内に静置した。 2 日後の死去率及び
 7 日後の羽化抑制率を測定し、その結果を第 2 表に示す。
 尚、羽化抑制率の評価は、A : 1 0 0 %、B : 9 0 % 以上

～ 1 0 0 % 未 満、 C : 5 0 % 以 上 ～ 9 0 % 未 満、 D :
5 0 % 未 満 と し た。

第 2 表

	供試化合物	供試化合物の濃度 (p p m)	死虫率 (%)	羽化抑制率 (%)
5	1	4 0 0	9 8	A
	2	4 0 0	1 0 0	A
	3	4 0 0	1 0 0	A
	4	4 0 0	1 0 0	A
	5	4 0 0	1 0 0	B
	6	4 0 0	1 0 0	B
	7	4 0 0	1 0 0	A
10	8	4 0 0	1 0 0	A
	9	4 0 0	1 0 0	A
	1 0	4 0 0	9 8	A
	1 1	4 0 0	1 0 0	A
	1 2	4 0 0	9 8	A
	1 3	4 0 0	1 0 0	A
	1 4	4 0 0	1 0 0	A
15	1 5	4 0 0	1 0 0	A
	1 6	4 0 0	1 0 0	A
	1 7	4 0 0	1 0 0	A
	1 8	4 0 0	1 0 0	A
	1 9	4 0 0	1 0 0	A
	2 0	4 0 0	1 0 0	A
	2 1	4 0 0	1 0 0	A
20	2 2	4 0 0	1 0 0	A
	2 3	4 0 0	1 0 0	A
	2 4	4 0 0	1 0 0	A
	2 5	4 0 0	9 5	B
	2 6	4 0 0	1 0 0	A

第 2 表 (続き)

供試化合物	供試化合物の濃度 (ppm)	死虫率 (%)	羽化抑制率 (%)
27	400	100	A
28	400	100	A
29	400	100	A
30	400	100	A
31	400	100	A
32	400	100	A
33	400	100	B
34	400	100	A
35	400	100	A
36	400	100	A
37	400	100	A
38	400	98	B
39	400	100	A
40	400	100	A
41	400	100	A
42	400	100	A
43	400	100	A
44	400	100	A
45	400	100	A
46	400	100	A
47	400	100	A
48	400	100	B
49	400	98	A
50	400	100	A
51	400	100	A
52	400	100	A
53	400	100	A
54	400	100	A
55	400	100	A

第 2 表 (続き)

供試化合物	供試化合物の濃度 (ppm)	死虫率 (%)	羽化抑制率 (%)
56	400	95	A
57	400	100	A
58	400	90	A
59	400	100	A
60	400	100	A
61	400	100	A
62	400	100	A
63	400	100	A
64	400	100	A
65	400	100	B

10 試験例 3 (サツマイモネコブセンチュウに対する試験)

本発明化合物 1 mg をアセトン 100 μ l に溶解した。
これを 0.1% ツィーン 80 を含む水溶液 9900 μ l
に添加して、溶液 10 ml を調製した。

15 10 ml 容のサンプル瓶の中に 120 $^{\circ}$ C で 3 時間乾燥
させた 100 ~ 20 メッシュの砂 (川砂) 8 g、サツマ
イモネコブセンチュウの 2 期幼虫 (L2) 500 個体
を含む線虫懸濁液 1 ml、上記で調製した溶液 (本発明化
合物濃度: 100 ppm) 1 ml を順に入れ、25 $^{\circ}$ C 恒
温器 (暗黒) 内で 24 時間放置した。その後、根系を切
20 除したトマト幼苗 (第 1 本葉展開時) を砂中に数 mm 挿
し、25 $^{\circ}$ C アッセイ室に静置した。処理 14 日後に根を

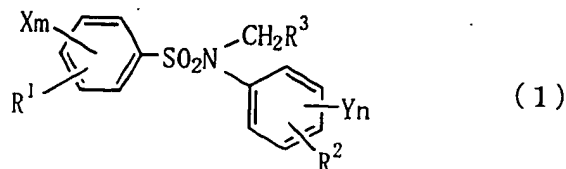
水洗、根瘤数を調査し、防除率を算出した。結果を第3表に示す。

第 3 表

	供試化合物	供試化合物の濃度 (p p m)	防除率 (%)
5	5	1 0 0	1 0 0
	1 6	1 0 0	1 0 0
	1 7	1 0 0	1 0 0
	1 8	1 0 0	1 0 0
	1 9	1 0 0	1 0 0
	2 0	1 0 0	1 0 0
	3 0	1 0 0	1 0 0
	3 1	1 0 0	1 0 0
10	3 2	1 0 0	1 0 0
	3 6	1 0 0	1 0 0
	3 7	1 0 0	1 0 0
	3 8	1 0 0	1 0 0
	4 7	1 0 0	1 0 0
	4 8	1 0 0	9 8
	4 9	1 0 0	1 0 0
15	5 0	1 0 0	1 0 0
	5 4	1 0 0	9 8

請 求 の 範 囲

1. 一般式



〔式中、 R^1 及び R^2 は、同一又は異なって、水素原子、低級ハロアルキル基又はハロゲン原子を示す。 R^3 は、エチニル基、シアノ基、低級アルコキシ基又は低級アルコキシカルボニル基を示す。 X 及び Y は、同一又は異なって、水素原子、ハロゲン原子、低級アルキル基、低級アルコキシ基、低級ハロアルキル基、低級ハロアルコキシ基、置換基を有することのあるフェノキシ基、置換基を有することのあるフェニル基、置換基を有することのあるピリジルオキシ基、シアノ基、ニトロ基、低級アルキルチオ基又は低級アルキルスルホニル基を示す。 m 及び n はそれぞれ1～3の整数を示す。〕

で表わされるスルホンアミド誘導体。

- 20 2. 請求の範囲第1項に記載のスルホンアミド誘導体を有効成分として含有する殺虫、殺ダニ及び殺線虫剤。

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No.

PCT/JP96/01545

A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER

Int. Cl⁶ C07C311/21, C07C311/29, C07D213/42, A01N41/06, A01N43/40

According to International Patent Classification (IPC) or to both national classification and IPC

B. FIELDS SEARCHED

Minimum documentation searched (classification system followed by classification symbols)

Int. Cl⁶ C07C311/21, C07C311/29, C07D213/42, A01N41/06, A01N43/40

Documentation searched other than minimum documentation to the extent that such documents are included in the fields searched

Electronic data base consulted during the international search (name of data base and, where practicable, search terms used)

CAS ONLINE

C. DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category*	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
A	JP, 3-258771, A (Tosoh Corp.), November 19, 1991 (19. 11. 91) (Family: none)	1, 2
A	JP, 63-227552, A (Shionogi & Co., Ltd.), September 21, 1988 (21. 09. 88) (Family: none)	1, 2
A	JP, 47-41527, B1 (CIBA-Geigy AG.), October 20, 1972 (20. 10. 72) & DE, 2018688, A & FR, 2040427, A & GB, 1307287, A	1

☐ Further documents are listed in the continuation of Box C.

☐ See patent family annex.

* Special categories of cited documents:

"A" document defining the general state of the art which is not considered to be of particular relevance

"E" earlier document but published on or after the international filing date

"L" document which may throw doubts on priority claim(s) or which is cited to establish the publication date of another citation or other special reason (as specified)

"O" document referring to an oral disclosure, use, exhibition or other means

"P" document published prior to the international filing date but later than the priority date claimed

"T" later document published after the international filing date or priority date and not in conflict with the application but cited to understand the principle or theory underlying the invention

"X" document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered novel or cannot be considered to involve an inventive step when the document is taken alone

"Y" document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered to involve an inventive step when the document is combined with one or more other such documents, such combination being obvious to a person skilled in the art

"&" document member of the same patent family

Date of the actual completion of the international search
August 27, 1996 (27. 08. 96)

Date of mailing of the international search report
September 3, 1996 (03. 09. 96)

Name and mailing address of the ISA/
Japanese Patent Office

Authorized officer

Facsimile No.

Telephone No.

国際調査報告

国際出願番号 PCT/J P 96/01545

A. 発明の属する分野の分類 (国際特許分類 (IPC))

Int. Cl. C 07 C 3 1 1 / 2 1, C 0 7 C 3 1 1 / 2 9, C 0 7 D 2 1 3 / 4 2,
A 0 1 N 4 1 / 0 6, A 0 1 N 4 3 / 4 0

B. 調査を行った分野

調査を行った最小限資料 (国際特許分類 (IPC))

Int. Cl. C 0 7 C 3 1 1 / 2 1, C 0 7 C 3 1 1 / 2 9, C 0 7 D 2 1 3 / 4 2,
A 0 1 N 4 1 / 0 6, A 0 1 N 4 3 / 4 0

最小限資料以外の資料で調査を行った分野に含まれるもの

国際調査で利用した電子データベース (データベースの名称、調査に使用した用語)

CAS ONLINE

C. 関連すると認められる文献

引用文献の カテゴリー*	引用文献名 及び一部の箇所が関連するときは、その関連する箇所の表示	関連する 請求の範囲の番号
A	J P, 3-258771, A (東ソー株式会社) 19. 11月. 1991 (19. 11. 91) (ファミリーなし)	1, 2
A	J P, 63-227552, A (塩野義製薬株式会社) 21. 9月. 1988 (21. 09. 88) (ファミリーなし)	1, 2
A	J P, 47-41527, B1 (チバ・ガイギー・アクチエンゲゼルシャフト) 20. 10月. 1972 (20. 10. 72) & DE, 2018688, A & FR, 2040427, A & GB, 1307287, A	1

☐ C欄の続きにも文献が列挙されている。☐ パテントファミリーに関する別紙を参照。

* 引用文献のカテゴリー

「A」特に関連のある文献ではなく、一般的技術水準を示すもの

「E」先行文献ではあるが、国際出願日以後に公表されたもの

「L」優先権主張に疑義を提起する文献又は他の文献の発行日若しくは他の特別な理由を確立するために引用する文献 (理由を付す)

「O」口頭による開示、使用、展示等に言及する文献

「P」国際出願日前で、かつ優先権の主張の基礎となる出願

の日の後に公表された文献

「T」国際出願日又は優先日後に公表された文献であって出願と矛盾するものではなく、発明の原理又は理論の理解のために引用するもの

「X」特に関連のある文献であって、当該文献のみで発明の新規性又は進歩性がないと考えられるもの

「Y」特に関連のある文献であって、当該文献と他の1以上の文献との、当業者にとって自明である組合せによって進歩性がないと考えられるもの

「&」同一パテントファミリー文献

国際調査を完了した日

27. 08. 96

国際調査報告の発送日

03.09.96

国際調査機関の名称及びあて先

日本国特許庁 (ISA/J P)

郵便番号 100

東京都千代田区霞が関三丁目4番3号

特許庁審査官 (権限のある職員)

平山 美千恵

印

4 H

9357

電話番号 03-3581-1101 内線 3444

THIS PAGE BLANK (USPTO)

**This Page is Inserted by IFW Indexing and Scanning
Operations and is not part of the Official Record**

BEST AVAILABLE IMAGES

Defective images within this document are accurate representations of the original documents submitted by the applicant.

Defects in the images include but are not limited to the items checked:

- ☐ BLACK BORDERS
- ☐ IMAGE CUT OFF AT TOP, BOTTOM OR SIDES
- ☐ FADED TEXT OR DRAWING
- ☒ BLURRED OR ILLEGIBLE TEXT OR DRAWING
- ☐ SKEWED/SLANTED IMAGES
- ☐ COLOR OR BLACK AND WHITE PHOTOGRAPHS
- ☐ GRAY SCALE DOCUMENTS
- ☒ LINES OR MARKS ON ORIGINAL DOCUMENT
- ☒ REFERENCE(S) OR EXHIBIT(S) SUBMITTED ARE POOR QUALITY
- ☐ OTHER: _____

IMAGES ARE BEST AVAILABLE COPY.

As rescanning these documents will not correct the image problems checked, please do not report these problems to the IFW Image Problem Mailbox.

THIS PAGE BLANK (USPTO)